

Состав

действующее вещество: zolmitriptan;

1 таблетка содержит золмитриптана 5 мг;

вспомогательные вещества: маннит Е 421, кальция силикат, целлюлоза микрокристаллическая, аспартам, натрия крахмала (тип А), кросповидон (тип В), ароматизатор Orange flavour, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки, диспергируются в ротовой полости.

Основные физико-химические свойства: белые, круглые, плоские таблетки с фаской.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые при мигрени. Селективные агонисты 5HT₁-рецепторов серотонина. Золмитриптан. Код АТХ N02C C03.

Фармакодинамика

Золмитриптан является селективным агонистом рекомбинантных 5-HT_{1B} / 1D-рецепторов серотонина сосудов человека. Имеет умеренную родство с серотониновым 5-HT_{1A}-рецепторами, не имеет существенной аффинности или фармакологической активности по 5HT₂-, 5HT₃-, 5HT₄-серотониновых рецепторов, α₁-, α₂-, β₁-адренорецепторов, Н₁, Н₂-рецепторов, М -холиновых рецепторов, D₁-, D₂-допаминовых рецепторов.

Препарат вызывает вазоконстрикцию, преимущественно краниальных сосудов, блокирует высвобождение нейропептидов, в частности вазоактивного интестинального пептида, который является основным эффекторным транмиттером рефлекторного возбуждения, вызывает вазодилатацию, которая лежит в основе патогенеза мигрени. Приостанавливает развитие приступа мигрени без прямого анальгетического действия. Наряду с купирование мигреневых нападения ослабляет тошноту, рвоту (особенно при левосторонних атаках), фото- и фонофобия. Влияет на центры ствола головного мозга, связанные с мигренью, что объясняет устойчивый повторный эффект при лечении серии из нескольких приступов мигрени у одного пациента.

Высокоэффективный в комплексном лечении мигреневых статуса (серии из

нескольких тяжелых, следующих друг за другом, приступов мигрени продолжительностью 2-5 суток). Устраняет мигрень, ассоциированную с менструацией.

Действие препарата развивается через 15-20 мин и достигает максимума через час после приема. Максимальный эффект наблюдается при приеме во время развития приступа.

Фармакокинетика

При пероральном приеме хорошо всасывается в пищеварительном тракте. Абсорбция препарата не зависит от приема пищи. Средняя абсолютная биодоступность составляет примерно 40%. Связывание с белками плазмы - 25%. Время достижения максимальной концентрации составляет 1 час, терапевтическая концентрация в плазме поддерживается в течение последующих 4-6 часов. При повторном приеме кумуляции препарата не наблюдается.

Подлежит интенсивной биотрансформации в печени с образованием N-десметилметаболит, что имеет в 2-6 раз большую фармакологической активностью, чем исходное соединение. 85% максимальной концентрации в крови достигается в течение часа.

Вывод золмитриптана обусловлено, в основном, процессами биотрансформации в печени, после чего происходит выведение метаболитов с мочой. Существуют три основных метаболита: индолоцтова кислота (основной метаболит в плазме и моче), N-оксид- и N-десметиланалог. Активен только N-десметилированный метаболит. Плазменные концентрации N-десметилированный метаболита примерно в два раза ниже, чем концентрации исходного лекарственного вещества, он может усилить терапевтическое действие золмитриптана. При пероральном однократном применении более 60% выводится с мочой (главным образом, в форме метаболита - индолоцтовой кислоты), а почти 30% - с калом в форме исходного соединения. После введения общий клиренс в среднем составляет примерно 10 мл / мин / кг, из которых треть приходится на почечный клиренс. Почечный клиренс превышает скорость клубочковой фильтрации, что свидетельствует о секрецию в почечных канальцах. Объем распределения после внутривенного введения составляет 2,4 л / кг. Связывание золмитриптана и N-десметилированный метаболита с белками плазмы низкое (примерно 25%). Период полувыведения золмитриптана в среднем составляет 2,5-3 часа. Период полувыведения его метаболитов подобным, что свидетельствует о том, что их вывода ограничивается скоростью образования.

Почечный клиренс золмитриптана и всех его метаболитов у пациентов с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью, был снижен (в 7-8 раз) по сравнению со здоровыми добровольцами, хотя AUC исходного соединения и активного метаболита лишь незначительно увеличилась (на 16 и 35% соответственно), а период полувыведения вырос на 1 час и достиг 3-3,5 часа. Эти показатели находятся в пределах, определенных у здоровых добровольцев.

Фармакокинетика золмитриптана у здоровых добровольцев пожилого возраста и у здоровых молодых добровольцев была сходной.

Показания

Купирования приступов мигрени, сопровождающихся аурой и без ауры.

Противопоказания

Гиперчувствительность к активному веществу или любому компоненту препарата.

Тяжелая или умеренная артериальная гипертензия, а также легкое неконтролируемое повышение давления. Ишемическая болезнь сердца, в том числе инфаркт миокарда в анамнезе. Ангиоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала). Заболевания периферических сосудов. Симптомы или признаки, соответствующие ишемической болезни сердца.

Одновременный прием эрготамина, производных эрготамина (включая метисергид), суматриптана, Наратриптан или других агонистов рецепторов 5HT_{1B} / 1D.

Цереброваскулярные нарушения и транзиторная ишемическая атака (ТИА) в анамнезе.

КК ниже 15 мл / мин.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Были проведены исследования взаимодействия лекарственного средства с кофеином, эрготамином, дигидроэрготамином, парацетамолом, метоклопрамидом, пизотифеном, флуоксетином, рифампицином и пропранололом, и не было выявлено клинически значимых различий в фармакокинетике золмитриптана или его активного метаболита.

Учитывая данные, полученные с участием здоровых добровольцев, между Золмитриптан и эрготамином не наблюдается никакой фармакокинетического взаимодействия или любой взаимодействия, должна клиническое значение. Поскольку теоретически может возрасти риск возникновения коронароспазма, Рапимиг рекомендуется принимать не ранее чем через 24 часа после применения препаратов с содержанием эрготамин. И наоборот, препарат с содержанием эрготамин рекомендуется принимать не ранее чем через 6 часов после применения Рапимига.

После приема моклобемида, специфического ингибитора MAO-A, наблюдалось незначительное увеличение (26%) AUC (площади под кривой) золмитриптана и трехкратное увеличение AUC активного метаболита. Поэтому пациентам, которые применяют ингибитор MAO-A, принимать золмитриптан рекомендуется в дозе не более 5 мг в сутки. Препараты не должны применяться одновременно при приеме моклобемида в дозах более 150 мг дважды в сутки.

После приема циметидина, общего ингибитора P450, период полувыведения золмитриптана рос на 44%, а AUC - на 48%. Кроме того, циметидин удваивал период полувыведения и AUC активного, N-десметилированный метаболита (183C91). Пациентам, принимающим циметидин, принимать золмитриптан рекомендуется в дозе не более 5 мг в сутки. Несмотря на общий профиль взаимодействия, нельзя исключать возможное взаимодействие со специфическими ингибиторами CYP 1A2. Поэтому при применении подобных соединений, таких как флувоксамин и хинолоны (например ципрофлоксацин), дозу так же рекомендуется уменьшать.

С точки зрения фармакокинетики, селегилин (ингибитор MAO-B) и флуоксетин (СИОЗС) с Золмитриптан не взаимодействуют. Однако после одновременного применения триптанов и селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (СИОЗС) или ингибиторов обратного захвата серотонина и норадреналина (ИЗЗСиН) сообщалось о появлении серотонинового синдрома (включая изменение психического состояния, вегетативную лабильность, нервно-мышечные аномалии).

Подобно другим агонистов рецепторов 5HT_{1B} / 1D золмитриптан может замедлять всасывание других лекарственных средств.

Следует избегать одновременного применения других 5HT_{1B} / 1D-агонистов при лечении Золмитриптан течение 24 часов. Так же, следует избегать одновременного применения золмитриптана при лечении другими 5HT_{1B} / 1D-агонистами в течение 24 часов.

Особенности применения

Рапимиг нужно применять только тогда, когда точно установлен диагноз мигрени. Перед началом лечения головных болей у пациентов, у которых ранее мигрень НЕ диагностировалась, или у пациентов, склонных к мигрени, у которых наблюдаются атипичные симптомы, следует исключить другие неврологические состояния. Рапимиг не следует назначать при гемиплегической, базилярной и офтальмоплегической мигрени. У пациентов, принимающих агонисты 5HT_{1B} / 1D, возможно возникновение инсульта и других побочных цереброваскулярных нарушений. У лиц, склонных к мигрени, могут появиться определенные симптомы, связанные с цереброваскулярной недостаточностью.

Рапимиг не следует назначать пациентам, страдающим симптоматический синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта или аритмии, связанные с другими дополнительными сердечными проводящими путями.

В редких случаях, так же как и при применении других агонистов 5HT_{1B} / 1D, сообщают о коронарораспизме, стенокардию и инфаркт миокарда. При наличии факторов, способствующих развитию ишемической болезни сердца (таких как курение, повышенное артериальное давление, гиперлипидемия, сахарный диабет, наследственность), Рапимиг следует назначать только после обследования сердечно-сосудистой системы пациента. Особое внимание следует уделять женщинам в период постменопаузы и мужчинам после 40 лет с такими факторами риска. Однако обследование не позволяет выявить каждого пациента с сердечными заболеваниями, поэтому случались единичные случаи серьезных сердечных событий у пациентов без сердечно-сосудистых нарушений в анамнезе.

Некоторые пациенты после приема чувствовали тяжесть, давление или сжатия в области сердца, как и в случае применения других агонистов 5HT_{1B} / 1D. При появлении боли в груди или симптомов, характерных для ишемической болезни сердца, применение Рапимигу следует прекратить до проведения соответствующего медицинского обследования.

У пациентов как с повышением артериального давления в анамнезе, так и с нормальным артериальным давлением возможно преходящее повышение артериального давления, как и в случае применения других агонистов 5HT_{1B} / 1D. Очень редко такое повышение артериального давления связано с серьезными клиническими проявлениями. Применять Рапимиг следует в дозе, не превышающей рекомендуемую.

При одновременном применении триптанов и травяных сборов, которые содержат зверобой, частота побочных реакций может увеличиваться.

Сообщалось о возникновении серотонинового синдрома (включая изменение психического состояния, вегетативную лабильность, нервно-мышечные аномалии) после одновременного применения триптанов и селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (СИОЗС) или ингибиторов обратного захвата серотонина и норадреналина (ИЗЗСиН). Эти реакции могут быть тяжелыми. Если одновременное применение золмитриптана и СИОЗС и ИЗЗСиН клинически целесообразным, рекомендуется провести соответствующее обследование пациента, особенно в начале лечения, с увеличением дозы или применением другого серотонинергического средства (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Длительное применение любого болеутоляющего при головной боли может усилить боль. В такой ситуации необходимо прекратить лечение и обратиться к врачу. Диагноз головной боли, вызванного чрезмерным лечением, следует подозревать у пациентов с частыми или ежедневными головными болями, не уменьшаются регулярным применением лекарственных средств или является следствием такого лечения.

Рапимиг содержит аспартам (источник фенилаланина), что может нанести вред пациентам, страдающим фенилкетонурией. 1 таблетка 2,5 мг содержит 4 мг аспартама, 1 таблетка 5 мг - 8 мг аспартама.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Во время приема препарата небольшой группой здоровых добровольцев в дозировке до 20 мг не было отмечено существенного влияния на результаты психомоторных тестов.

Но водителей транспортных средств и лиц, работа которых связана с повышенной концентрацией внимания, необходимо предупредить, что в случае возникновения приступа мигрени возможно развитие сонливости и других симптомов.

Применение в период беременности или кормления грудью

Безопасность применения золмитриптана в период беременности не установлена. В период беременности Рапимиг применяют только в случае, когда возможный терапевтический эффект для матери превышает потенциальный риск для плода / ребенка.

Нет данных относительно проникновения золмитриптана в грудное молоко. Поэтому женщинам в период грудного кормления применять Рапимиг следует с осторожностью. Влияние на младенца необходимо минимизировать, для чего кормить грудью его следует не ранее чем через 24 часа после приема препарата матерью.

Способ применения и дозы

Препарат не предназначен для применения с целью профилактики мигреневых нападения. Рапимиг рекомендуется применять как можно раньше после возникновения приступа мигрени, хотя эффективность препарата не зависит от того, через какое время после начала приступа была принята таблетка.

Таблетку можно не запивать жидкостью. Таблетку кладут на язык, где она растворяется и проглатывается со слюной. Эта лекарственная форма может применяться в ситуациях, когда жидкости под рукой нет, или во избежание тошноты и рвоты, которые могут возникнуть при запивании таблетки жидкостью.

Данная лекарственная форма быстро растворяется в полости рта, однако иногда все-таки возможна задержка абсорбции золмитриптана и отсрочки начала действия препарата.

Блистерную упаковку нужно раскрыть путем очистки ее от фольги, а не путем продавливания фольги таблеткой.

Рекомендуемая доза Рапими́га для снятия мигреневых нападения - 1 таблетка (2,5 мг). Если симптомы не исчезают или появляются повторно в течение 24 часов, эффективным может быть применение второй дозы. Если применение второй дозы необходимо, ее следует принять не ранее чем через 2 часа после первой. При недостаточной эффективности дозы 2,5 мг допускается увеличение разовой дозы до 5 мг (высшая разовая доза).

Максимальная суточная доза не должна превышать 10 мг. В течение 24-часового периода не следует применять более 2 дозы золмитриптана.

Пациенты в возрасте от 65 лет

Безопасность и эффективность применения таблеток золмитриптана пациентам в возрасте от 65 лет не исследовались. Поэтому лекарственное средство золмитриптан не рекомендуется для лечения указанной выше категории пациентов.

Печеночная недостаточность

Для пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени коррекции дозы не требуется. Для пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени суточная доза не должна превышать 5 мг.

Почечная недостаточность

При КК более 15 мл / мин дозу корректировать не нужно.

Взаимодействия, требующих коррекции дозы (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»)

Пациентам, принимающим ингибиторы МАО-А, принимать золмитриптан рекомендуется в дозе не более 5 мг в сутки. Максимальная рекомендованная суточная доза золмитриптана для пациентов, принимающих циметидин, составляет не более 5 мг в сутки.

Максимальная суточная доза золмитриптана 5 мг рекомендуется для пациентов, которые принимают специфические ингибиторы CYP1A2, такие как флувоксамин и хинолоны (например ципрофлоксацин).

Дети

Препарат применяют для лечения детей (в возрасте до 18 лет).

Передозировка

Симптомы: у добровольцев, принимавших однократно золмитриптан в дозе 50 мг, наблюдался седативный эффект. Наблюдение за пациентами в случае передозировки должен продолжаться по крайней мере 15 часов или до исчезновения симптомов или признаков.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля. В случае тяжелой интоксикации рекомендуются процедуры интенсивной терапии, в т. ч. обеспечение проходимости дыхательных путей, адекватной оксигенации и вентиляции, мониторинг и поддержание функций сердечно-сосудистой системы. Специфического антидота нет.

Неизвестно, как гемодиализ и перитонеальный диализ влияет на сывороточную концентрацию золмитриптана.

Побочные реакции

Побочные эффекты обычно являются преходящими, появляются в течение 4 часа после приема препарата, а не учащаются после его повторного применения и

исчезают спонтанно без всякого дополнительного лечения.

По частоте возникновения побочные эффекты классифицируются следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100 < 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000 < 1/100$); редко ($\geq 1/10000 < 1/1000$); Очень редко ($< 1/10000$), неизвестно (нельзя оценить по имеющимся данным). В каждой группе побочные реакции представлены в порядке уменьшения их серьезности.

Со стороны иммунной системы: редко - реакции гиперчувствительности, включая крапивницу, отек Квинке и анафилактические реакции.

Со стороны нервной системы: часто - нарушение чувствительности, головокружение, головная боль, гиперестезии, парестезии, сонливость, чувство жара.

Со стороны сердца: часто - сердцебиение; нечасто - тахикардия очень редко - инфаркт миокарда, стенокардия, коронарospазм.

Со стороны сосудов: нечасто - незначительное повышение артериального давления, временное повышение системного артериального давления.

Со стороны пищеварительной системы: часто - боль в животе, тошнота, рвота, сухость во рту, дисфагия; очень редко - ишемия или инфаркт (например интестинальная ишемия, интестинальный инфаркт, инфаркт селезенки), что может проявляться диареей с примесью крови или болью в брюшной полости.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - мышечная слабость, боль в мышцах.

Со стороны мочеполовой системы: нечасто - полиурия, частое мочеиспускание очень редко - императивные позывы к мочеиспусканию.

Общие нарушения: часто - астения, ощущение тяжести, сжатия, боли или давления в горле, шее, грудной клетке и конечностях.

Определенные симптомы могут принадлежать самой мигрени.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 ° C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 6 таблеток в блистере, по 1 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Актавис ЛТД.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

BLB015, BLB 016 Булебел Индастриал дом., Г. Зейтун ZTN 3000, Мальта.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).